



#3  
1/23 1626  
01-04-02

0283-0161P

RECEIVED

DEC 27 2001

TECH CENTER 1600/2300

IN THE U.S. PATENT AND TRADEMARK OFFICE

Applicant: MIYATA et al. Conf.: 7946  
Appl. No.: 09/988,042 Group: UNASSIGNED  
Filed: November 16, 2001 Examiner: ANDERSON  
For: 7A-ALKOXY-4H-PYRANO [3,2-D] -OXAZOL-  
2(3H)-ONE AND PROCESS FOR PRODUCING THE  
SAME

LETTER

Assistant Commissioner for Patents  
Washington, DC 20231

December 20, 2001

Sir:

Under the provisions of 35 U.S.C. § 119 and 37 C.F.R. § 1.55(a), the applicant(s) hereby claim(s) the right of priority based on the following application(s):

<u>Country</u>	<u>Application No.</u>	<u>Filed</u>
JAPAN	2000-349456	November 16, 2000

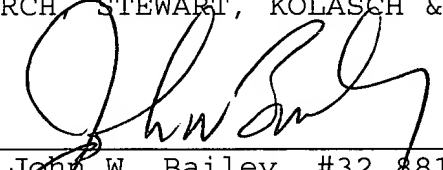
A certified copy of the above-noted application(s) is(are) attached hereto.

If necessary, the Commissioner is hereby authorized in this, concurrent, and future replies, to charge payment or credit any overpayment to Deposit Account No. 02-2448 for any additional fee required under 37 C.F.R. §§ 1.16 or 1.17; particularly, extension of time fees.

Respectfully submitted,

BIRCH, STEWART, KOLASCH & BIRCH, LLP

By

  
John W. Bailey, #32,881

JWB/end  
0283-0161P

P.O. Box 747  
Hills Church, VA 22040-0747  
(703) 205-8000

Attachment



日本国特許庁  
JAPAN PATENT OFFICE

MIYATA et al.  
Appl. No. 09/988,042  
Filed Nov. 16, 2001  
Docket No. 0283-0161P  
Birch, Stewart, Kolasch  
& Birch, LLP  
(703) 205-8000

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office

出願年月日

Date of Application:

2000年11月16日

出願番号

Application Number:

特願2000-349456

出願人

Applicant(s):

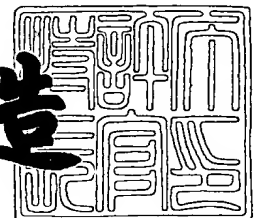
宇部興産株式会社

RECEIVED  
DEC 27 2001  
TECHNICAL CENTER 1600/2900

2001年11月26日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

及川耕造



出証番号 出証特2001-3103295

【書類名】 特許願

【整理番号】 TSP001103

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 C07D263/52

【発明者】

【住所又は居所】 山口県宇部市大字小串 1 9 7 8 番地の 5  
宇部興産株式会社 宇部研究所内

【氏名】 宮田 博之

【発明者】

【住所又は居所】 山口県宇部市大字小串 1 9 7 8 番地の 5  
宇部興産株式会社 宇部研究所内

【氏名】 本間 貴志

【発明者】

【住所又は居所】 山口県宇部市大字小串 1 9 7 8 番地の 5  
宇部興産株式会社 宇部研究所内

【氏名】 山本 康仁

【発明者】

【住所又は居所】 山口県宇部市大字小串 1 9 7 8 番地の 5  
宇部興産株式会社 宇部研究所内

【氏名】 安宅 喜久雄

【特許出願人】

【識別番号】 000000206

【氏名又は名称】 宇部興産株式会社

【代表者】 常見 和正

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 012254

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

特 2 0 0 0 - 3 4 9 4 5 6

【物件名】	要約書	1
【プルーフの要否】	要	

【書類名】 明細書

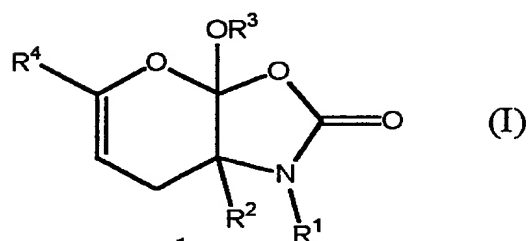
【発明の名称】 7 a - アルコキシ - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン類、及びその製造法

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I)

【化 1】



(式中、 $R^1$ は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アリール基又はアラアルキル基を示し、 $R^2$ は水素原子、アルキル基、アルケニル基、アリール基又はアラアルキル基を示し、 $R^3$ はアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基（但し、2-アルケニル基を除く）、アリール基又はアラアルキル基を示し、 $R^4$ はアルキル基、アリール基、アルコキシカルボニル基又シアノ基を示す。)

で示される 7 a - アルコキシ - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン類。

【請求項 2】

$R^1$ がアルキル基、フェニル基又はアラアルキル基を示し、 $R^2$ が水素原子、アルキル基、アルケニル基、アラアルキル基又はアリール基を示し、 $R^3$ がアルキル基、シクロアルキル基又はアリール基を示し、 $R^4$ がアルキル基又はアリール基を示す請求項 1 記載の 7 a - アルコキシ - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン類。

【請求項 3】

$R^1$ がベンジル基、1-フェニルエチル基、ジフェニルメチル基、フェニル基、(1-ナフチル)メチル基又は1-(1-ナフチル)エチル基を示し、 $R^2$ が水素原子、メチル基、エチル基、n-プロピル基又はイソプロピル基を示し、 $R^3$ がメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、フェニル基、t e

r t-ブチル基、シクロヘキシル基、メンチル基又は8-フェニルメンチル基を示し、R<sup>4</sup>がメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、t e r t-ブチル基又はフェニル基を示す請求項1記載の7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類。

【請求項4】

一般式(I)で示される7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類が、

3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-メンチルオキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-3a-メチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-t e r t-ブチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-イソブチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-フェニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-フェニルエチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-フェニルエチル)-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラ

ノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-(1-フェニルエチル)-7a-(1)-メンチルオキシ-6-メチル  
 -4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-(1-フェニルエチル)-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3  
 , 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-(1-フェニルエチル)-7a-メトキシ-6-n-ブチル-4H-ピラノ  
 [3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキ  
 サゾール-2 (3H) -オン、  
 3-ベンジル-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]  
 -オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-ベンジル-7a-(1)-メンチルオキシ-6-メチル-4H-ピラノ  
 [3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-tert-ブチル-4H-ピラノ[3, 2  
 -d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキ  
 サゾール-2 (3H) -オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3, 2-d]  
 -オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-フェニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オ  
 キサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-(1-(1-ナフチル)エチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピ  
 ラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-(1-ナフチル)メチル-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラ  
 ノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-(1-ナフチル)メチル-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3  
 , 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、  
 3-(1-ナフチル)メチル-7a-メトキシ-6-tert-ブチル-4H-  
 ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H) -オン、

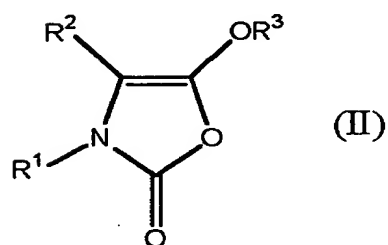
3-(1-ナフチル)メチル-7a-メトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン

からなる群より選ばれる少なくとも一種の化合物である請求項1に記載の7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類。

【請求項5】

ルイス酸の存在下、一般式(II)

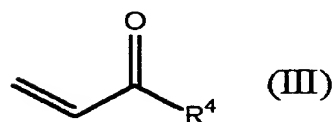
【化2】



(式中、R¹、R²及びR³は、前記と同義である。)

で示される5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類に、一般式(III)

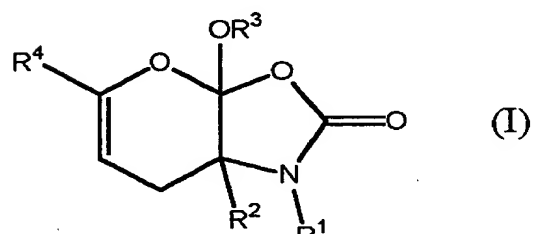
【化3】



(式中、R⁴は、前記と同義である。)

で示されるα,β-不飽和ケトン類を有機溶媒中で反応させることを特徴とする、一般式(I)

【化4】



(式中、R¹、R²、R³及びR⁴は、前記と同義である。)

で示される7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類の製造法。



【請求項 6】

ルイス酸が、一般式 (IV)

【化 5】



(式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ は、炭素数 1～6 のアルキル基を示し、Tf は、トリフルオロメタンスルホニル基を示す。)

である請求項 5 記載の 7 a - アルコキシ - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン類の製造法。

【発明の詳細な説明】

【0 0 0 1】

【発明の属する技術分野】

本発明は、医薬・農薬の合成原料、中間体及び他のファインケミカル製品合成原料として利用出来る、新規な 7 a - アルコキシ - 4 H - ピラノ [2, 3 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン類、及びその製造法に関する。本発明によって得られる 3 - ジフェニルメチル - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [2, 3 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オンは、例えば、塩化メチレン中でトリフルオロ酢酸と反応させた後に、Pd/C 触媒の存在下で水素を反応させることにより、医薬・農薬品の合成原料、中間体として有用な 5 - メチルプロリンメチルエステルに誘導出来る (後の参考例 1 に記載)。

【0 0 0 2】

【従来技術】

従来、ルイス酸存在下、5 - アルコキシ - 2 (3 H) - オキサゾロン類にアルデヒド類を有機溶媒中で反応させることによって、4 - アルコキシカルボニル - 2 - オキサゾリジノン類を製造する方法は知られている (特開平 9 - 1 8 5 1 5 0 号公報)。しかしながら、ルイス酸存在下、5 - アルコキシ - 2 (3 H) - オキサゾロン類に  $\alpha$ ,  $\beta$  - 不飽和ケトン類を有機溶媒中で反応させる方法、及びそれによって得られる 7 a - アルコキシ - 4 H - ピラノ [2, 3 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン類は全く知られていなかった。

【0 0 0 3】

【発明が解決しようとする課題】

本発明の課題は、即ち、医薬・農薬の合成原料及び他のファインケミカル製品合成原料として利用出来る、新規な 7a-アルコキシ-4H-ピラノ[2,3-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類、及びその製造法を提供するものである。

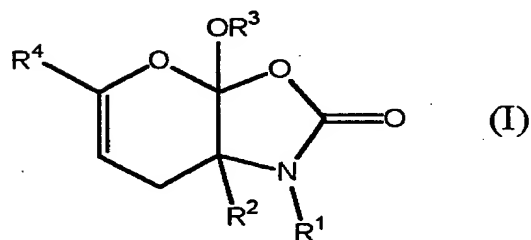
【0004】

【課題を解決するための手段】

本発明は、一般式 (I)

【0005】

【化6】



【0006】

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は、前記と同義である。)

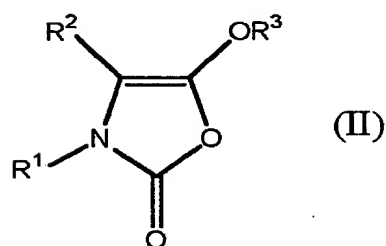
で示される 7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類によって解決される。

【0007】

本発明は、又、ルイス酸の存在下、一般式 (II)

【0008】

【化7】



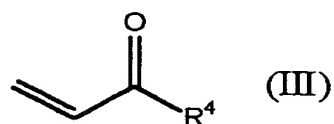
【0009】

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は、前記と同義である。)

で示される5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類に、一般式(III)

【0010】

【化8】



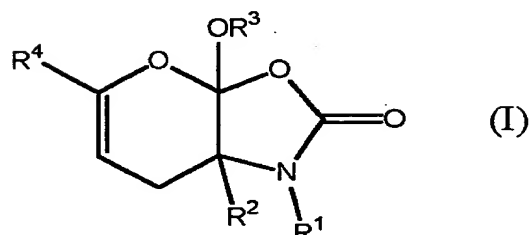
【0011】

(式中、R<sup>4</sup>は、前記と同義である。)

で示される $\alpha$ , $\beta$ -不飽和ケトン類を有機溶媒中で反応させることを特徴とする、一般式(I)

【0012】

【化9】



【0013】

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、前記と同義である。)

で示される7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類の製造法によっても解決される。

【0014】

【発明の実施の形態】

本発明における、7a-アルコキシ-4H-ピラノ[2,3-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類(以下、化合物(I)と称することもある)は一般式(I)で示される。

【0015】

化合物(I)においてR<sup>1</sup>が示すアルキル基とは、直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基(異性体を含む)、ブチル基(各異性体を含む)、ペンチル基(各異性体を含む)、ヘキシル基(

各異性体を含む)、ヘプチル基(各異性体を含む)、オクチル基(各異性体を含む)、ノニル基(各異性体を含む)、デシル基(各異性体を含む)、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基、メンチル基のような炭素数1~10の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基が挙げられるが、好ましくは炭素数1~6の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基、更に好ましくはメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基である。

## 【0016】

化合物(I)において $R^1$ が示すアルケニル基とは、直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基を意味し、例えば、ビニル基、プロペニル基(異性体を含む)、ブテニル基(各異性体を含む)、ペンテニル基(各異性体を含む)、ヘキセニル基(各異性体を含む)、ヘプテニル基(各異性体を含む)、オクテニル基(各異性体を含む)、ノネニル基(各異性体を含む)、デセニル基(各異性体を含む)等の炭素数2~10の直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基が挙げられるが、好ましくは炭素数2~6の直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基、更に好ましくはビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基である。

## 【0017】

化合物(I)において $R^1$ が示すアリール基とは、(1)「置換基を有していないアリール基」又は(2)「置換基を有するアリール基」を意味する。

## 【0018】

前記の(1)「置換基を有していないアリール基」としては、例えば、フェニル基、ナフチル基、アントラセニル基、フェナントリル等が挙げられるが、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。

## 【0019】

前記の(2)「置換基を有するアリール基」のアリール基としては、前記(1)

）「置換基を有していないアリール基」のアリール基で定義したものと同一意味を示し、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。

（２）「置換基を有するアリール基」の置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、ブチル基（各異性体を含む）、ペンチル基（各異性体を含む）、ヘキシル基（各異性体を含む）等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1～6 のアルキル基；ヒドロキシ基；ニトロ基；シアノ基；ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子）；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基（各異性体を含む）、ブトキシ基（各異性体を含む）、ペンチルオキシ基（各異性体を含む）、ヘキシルオキシ基（各異性体を含む）等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1～6 のアルコキシ基；メチル基、エチル基、プロピル基等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1～6 のアルキル基で置換されていても良いアミノ基；ベンジルオキシ基等のアラルキルオキシ基；トリメチルシリルオキシ基等が挙げられるが、好ましくは、炭素数 1～6 のアルキル基、炭素数 1～6 のアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、アラルキルオキシ基、トリメチルシリルオキシ基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*tert*-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、*tert*-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、ベンジルオキシ基である。これらの置換基は、数や位置は限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していても良い。

## 【0020】

化合物（I）において  $R^1$  が示すアラルキル基とは、（３）「置換基を有していないアラルキル基」又は（４）「置換基を有するアラルキル基」を意味する。

## 【0021】

前記の（３）「置換基を有していないアラルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、1-（1-ナフチル）エチル基、1-ナフチルメチル基、1-（2-ナフチル）エチル基等が挙げられるが、好ましくはベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-（1-ナフチル）エチル基、1-（2-ナフチル）エチル基、1-ナフチルメチル基、1-フェニルブ

ロピル基、ジフェニルメチル基、トリチル基、更に好ましくはベンジル基、1-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、ジフェニルメチル基である。

#### 【0022】

前記の(4)「置換基を有するアラルキル基」のアラルキル基としては、前記(3)「置換基を有していないアラルキル基」で定義したアラルキル基と同じ意味を示し、好ましくはベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、1-フェニルプロピル基、ジフェニルメチル基、更に好ましくはベンジル基、1-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、ジフェニルメチル基である。(4)「置換基を有するアラルキル基」の置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル、ブチル基(各異性体を含む)、ペンチル基(各異性体を含む)、ヘキシル基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルキル基；ヒドロキシ基；ニトロ基；シアノ基；ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子)；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基(各異性体を含む)、ブトキシ基(各異性体を含む)、ペンチルオキシ基(各異性体を含む)、ヘキシルオキシ基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルコキシ基；メチル基、エチル基、プロピル基等の直鎖状又は分岐状の炭素原子数1~6のアルキル基で置換されていても良いアミノ基；ベンジルオキシ基等のアラルキルオキシ基；トリメチルシリルオキシ基等が挙げられるが、好ましくは炭素数1~6のアルキル基、炭素数1~6のアルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アラルキルオキシ基、トリメチルシリルオキシ基、更に好ましくはメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、tert-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、tert-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、ベンジルオキシ基である。これらの置換基は、数や位置を限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していても良い。

#### 【0023】

化合物 (I) の  $R^1$  の具体例としては、例えば、水素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、ビニル基、プロペニル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキセニル基、フェニル基、2-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、3, 4-ジベンジルオキシフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-*tert*-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、3, 4-ジメチルフェニル基、4-エチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、2, 4-ジエトキシフェニル基、ベンジル基、(1-ナフチル)メチル基、1-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、ジフェニルメチル基、1-(2-フェナントリル)エチル基、1-(9-アントラニル)エチル基、トリチル基、4-ニトロベンジル基、1-(4-ニトロフェニル)エチル基、4-シアノベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、4-トリメチルシリルオキシベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、2-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、1-(4-ブロモフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、ジ(4-クロロフェニル)メチル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-*tert*-ブチルベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4-ジメトキシベンジル基、2, 4-ジ

メトキシベンジル基、2-エトキシベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-tert-ブトキシベンジル基、1-(4-メトキシフェニル)エチル基、ジ(4-メトキシフェニル)メチル基等が挙げられるが、好ましくはメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、ビニル基、プロペニル基、ブテニル基、フェニル基、2-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、3,4-ジベンジルオキシフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2,4-ジメチルフェニル基、3,4-ジメチルフェニル基、4-エチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、ベンジル基、(1-ナフチル)メチル基、1-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、ジフェニルメチル基、4-ニトロベンジル基、1-(4-ニトロフェニル)エチル基、4-ベンジルオキシベンジル基、4-トリメチルシリルオキシベンジル基、3,4-ジクロロベンジル基、2-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、ジ(4-クロロフェニル)メチル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、2,4-ジメチルベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、2,4-ジメトキシベンジル基、2-エトキシベンジル基、1-(4-メトキシフェニル)エチル基、ジ(4-メトキシフェニル)メチル基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、tert-ブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、ビニル基、プロペニル基、ブテニル基、フェニル基、3,4-ジベンジルオキシフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、4-クロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-メチルフ



フェニル基、4-メチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、3, 4-ジメチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、ベンジル基、(1-ナフチル)メチル基、1-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、ジフェニルメチル基、4-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4-ジメトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、ジ(4-メトキシフェニル)メチル基等が挙げられる。

## 【0024】

化合物(I)において $R^2$ が示すアルキル基とは、(5)「置換基を有していないアルキル基」又は(6)「置換基を有するアルキル基」を意味する。

## 【0025】

前記の(5)「置換基を有していないアルキル基」としては、例えば、直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基(異性体を含む)、ブチル基(各異性体を含む)、ペンチル基(各異性体を含む)、ヘキシル基(各異性体を含む)、ヘプチル基(各異性体を含む)、オクチル基(各異性体を含む)、ノニル基(各異性体を含む)、デシル基(各異性体を含む)、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基、メンチル基のような炭素数1~10の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基を挙げられるが、好ましくは炭素数1~6の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基、更に好ましくはメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基である。

## 【0026】

前記の(6)「置換基を有するアルキル基」のアルキル基としては、(5)「置換基を有していないアルキル基」のアルキル基で定義したものと同一意味を示し、好ましくは炭素数1~6の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基、更に好ましくはメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、

イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基である。(6)「置換基を有するアルキル基」の置換基としては、例えば、ヒドロキシ基；メトキシ基；ベンジルオキシ基；トリメチルシリルオキシ基；tert-ブチルジメチルシリルオキシ基；アセトキシ基；チオメチル基；インドリル基；イミダゾリル基；アシルアミノ基；メトキシカルボニル基；エトキシカルボニル基；tert-ブチルオキシカルボニル基；ベンジルオキシカルボニル基；グアニジル基；メルカプト基；アミノ基；tert-ブトキシカルボルアミノ基；ベンジルオキシカルボニルアミノ基；メトキシカルボニルアミノ基；エトキシカルボニルアミノ基；アミノカルボニル基等が挙げられるが、好ましくはメトキシ基、ベンジルオキシ基、tert-ブチルジメチルシリルオキシ基、アセトキシ基、チオメチル基、インドリル基、イミダゾリル基、アシルアミノ基、メトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボルアミノ基、ベンジルオキシカルボニルアミノ基、更に好ましくは、ベンジルオキシ基、tert-ブチルジメチルシリルオキシ基、アセトキシ基、チオメチル基、インドリル基、イミダゾリル基、メトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボルアミノ基である。これらの置換基は、数や位置を限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していても良い。

## 【0027】

化合物(I)において $R^2$ が示すアルケニル基とは、直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基を意味し、例えば、ビニル基、プロペニル基（異性体を含む）、ブテニル基（各異性体を含む）、ペンテニル基（各異性体を含む）、ヘキセニル基（各異性体を含む）、ヘプテニル基（各異性体を含む）、オクテニル基（各異性体を含む）、ノネニル基（各異性体を含む）又はデセニル基（各異性体を含む）などの炭素数1～10の直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基が挙げられるが、好ましくは炭素数2～6の直鎖状、分岐状または又は環状のアルケニル基、更に好ましくはビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基である。

## 【0028】

化合物 (I) において  $R^2$  が示すアリール基とは、(7) 「置換基を有していないアリール基」又は (8) 「置換基を有するアリール基」を意味する。

## 【 0 0 2 9 】

前記の (7) 「置換基を有していないアリール基」としては、例えば、フェニル基、ナフチル基、アントラセニル基、フェナントリル等が挙げられるが、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。

## 【 0 0 3 0 】

前記の (8) 「置換基を有するアリール基」のアリール基は (7) 「置換基を有していないアリール基」のアリール基で定義したものと同一意味を示し、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。(8) 「置換基を有するアリール基」の置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル、ブチル基 (各異性体を含む)、ペンチル基 (各異性体を含む)、ヘキシル基 (各異性体を含む) 等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1～6 のアルキル基；ヒドロキシル基；ニトロ基；シアノ基；ハロゲン原子 (フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子)；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基 (各異性体を含む)、ブトキシ基 (各異性体を含む)、ペンチルオキシ基 (各異性体を含む)、ヘキシルオキシ基 (各異性体を含む) 等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1～6 のアルコキシ基；メチル基、エチル基、プロピル基等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1～6 のアルキル基で置換されていても良いアミノ基；ベンジルオキシ基等のアラルキルオキシ基；トリメチルシリルオキシ基等が挙げられるが、好ましくは炭素数 1～6 のアルキル基、炭素数 1～6 のアルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ベンジルオキシ基、トリメチルシリルオキシ基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*tert*-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、*tert*-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、ベンジルオキシ基である。これらの置換基は、数や位置を限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していても良い。

## 【 0 0 3 1 】

化合物 (I) において  $R^2$  が示すアラルキル基とは、(9) 「置換基を有していな

「アラルキル基」又は(10)「置換基を有するアラルキル基」を意味する。

【0032】

前記の(9)「置換基を有していないアラルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、1-(2-ナフチル)エチル基等が挙げられるが、好ましくはベンジル基、2-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基、トリチル基、更に好ましくはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基である。

【0033】

前記の(10)「置換基を有するアラルキル基」のアラルキル基とは、前記(9)「置換基を有していないアラルキル基」で定義したアラルキル基と同じ意味を示し、好ましくはベンジル基、2-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基、トリチル基、更に好ましくはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基である。(10)の「置換基を有するアラルキル基」の置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル、ブチル基(各異性体を含む)、ペンチル基(各異性体を含む)、ヘキシル基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルキル基；ヒドロキシ基；ニトロ基；シアノ基；ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子)；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基(各異性体を含む)、ブトキシ基(各異性体を含む)、ペンチルオキシ基(各異性体を含む)、ヘキシルオキシ基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルコキシ基；メチル基、エチル基、プロピル基等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルキル基で

置換されていてもよいアミノ基；ベンジルオキシ基等のアラルキルオキシ基；、トリメチルシリルオキシ基等が挙げられるが、好ましくは、炭素数1～6のアルキル基、炭素数1～6のアルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ベンジルオキシ基、トリメチルシリルオキシ基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*tert*-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、*tert*-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、ベンジルオキシ基である。これらの置換基は、数や位置を限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していてもよい。

#### 【0034】

化合物(I)の $R^2$ の具体例としては、例えば、水素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基、メトキシメチル基、ベンジルオキシメチル基、1-(ベンジルオキシ)エチル基、トリメチルシリルオキシメチル基、*tert*-ブチルジメチルシリルオキシメチル基、アセトキシメチル基、メチルチオメチル基、インドリルメチル基、アミノカルボニルメチル基、4-*tert*-ブトキシカルボニルアミノブチル基、4-ベンジルオキシカルボニルアミノブチル基、メトキシカルボニルメチル基、2-メトキシカルボニルエチル基、エトキシカルボニルメチル基、2-メチルチオエチル基、イミダゾリルメチル基、3-グアニジルプロピル基、2-アミノカルボニルエチル基、ヒドロキシメチル基、メルカプトメチル基、ビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、2-ヘプテニル基、3-ヘプテニル基、4-ヘプテニル基、2-オクテニル基、3-オクテニル基、2-ノネニル基、2-デセニル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、アントラセニル基、フェナントリル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-ベンジルオキシフ

エニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、4-トリメチルシリルオキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、2-シアノフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、2-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、2-クロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ブロモフェニル基、4-ヨードフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、3-メトキシ-4-エトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、3,4-メチレンジオキシフェニル基、4-エチルフェニル基、4-n-プロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-モノメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、ジフェニルメチル基、トリチル基、4-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、4-エチルベンジル基、4-イソブチルベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、3,4-メチレンジオキシベンジル基、3,4-ジエトキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-トリメチルシリルオキシベンジル基、4-tert-ブチルジメチルシリルオキシベンジル基、4-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、2-ニトロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、2-フルオロベンジル基、4-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、2-クロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ヨードベンジル基、4-シアノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(4-tert-ブチルジメチルシリルオキシフェニル)エチル基、2-

(4-ニトロフェニル)エチル基等が挙げられるが、好ましくは水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ヘキシル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、メトキシメチル基、ベンジルオキシメチル基、1-(ベンジルオキシ)エチル基、トリメチルシリルオキシメチル基、*tert*-ブチルジメチルシリルオキシメチル基、アセトキシメチル基、メチルチオメチル基、インドリルメチル基、アミノカルボニルメチル基、4-*tert*-ブトキシカルボニルアミノブチル基、4-ベンジルオキシカルボニルアミノブチル基、メトキシカルボニルメチル基、2-メトキシカルボニルエチル基、エトキシカルボニルメチル基、2-(メチルチオ)エチル基、イミダゾリルメチル基、2-アミノカルボニルエチル基、ヒドロキシメチル基、メルカプトメチル基、ビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、4-トリメチルシリルオキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ヨードフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、4-*tert*-ブトキシフェニル基、3,4-メチレンジオキシフェニル基、4-エチルフェニル基、4-*n*-プロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-*tert*-ブチルフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、4-メチルベンジル基、4-エチルベンジル基、4-イソブチルベンジル基、4-イソプロピル

ベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4-ジメトキシベンジル基、3, 4-メチレンジオキシベンジル基、3, 4-ジエトキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、4-tert-ブチルジメチルシリルオキシベンジル基、4-ニトロベンジル基、2-ニトロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-フルオロベンジル基、4-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ヨードベンジル基、4-シアノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(4-tert-ブチルジメチルシリルオキシフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基、更に好ましくは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ヘキシル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、メトキシメチル基、ベンジルオキシメチル基、1-(ベンジルオキシ)エチル基、tert-ブチルジメチルシリルオキシメチル基、アセトキシメチル基、メチルチオメチル基、インドリルメチル基、アミノカルボニルメチル基、4-tert-ブトキシカルボニルアミノブチル基、4-ベンジルオキシカルボニルアミノブチル基、メトキシカルボニルメチル基、2-メトキシカルボニルエチル基、2-メチルチオエチル基、2-アミノカルボニルエチル基、ビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、4-トリメチルシリルオキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ヨードフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、2-



フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、4-メチルベンジル基、4-イソブチルベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、3,4-メチレンジオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、4-tert-ブチルジメチルシリルオキシベンジル基、4-ニトロベンジル基、4-フルオロベンジル基、4-クロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ヨードベンジル基、4-シアノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(4-tert-ブチルジメチルシリルオキシフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基である。

## 【0035】

化合物(I)において $R^3$ が示すアルキル基とは、直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基(異性体を含む)、ブチル基(各異性体を含む)、ペンチル基(各異性体を含む)、ヘキシル基(各異性体を含む)、ヘプチル基(各異性体を含む)、オクチル基(各異性体を含む)、ノニル基(各異性体を含む)、デシル基(各異性体を含む)、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基のような炭素数1~10の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基が挙げられるが、好ましくは炭素数1~6の直鎖状、分岐状もしくは環状のアルキル基、更に好ましくはメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基である。

## 【0036】

化合物(I)において $R^3$ が示すアルケニル基とは、直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基を意味し、例えば、ビニル基、プロペニル基(異性体を含む)、ブテニル基(各異性体を含む)、ペンテニル基(各異性体を含む)、ヘキセニル基(各異性体を含む)、ヘプテニル基(各異性体を含む)、オクテニル基(各異性

体を含む)、ノネニル基(各異性体を含む)、デセニル基(各異性体を含む)等の炭素数2~10の直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基が挙げられるが、好ましくは炭素数2~6の直鎖状、分岐状又は環状のアルケニル基、更に好ましくはビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基である。

## 【0037】

化合物(I)において $R^3$ が示すアリール基としては、(11)「置換基を有していないアリール基」又は(12)「置換基を有するアリール基」を意味する。

## 【0038】

前記の(11)「置換基を有していないアリール基」としては、例えば、フェニル基、ナフチル基、アントラセニル基、フェナントリル等が挙げられるが、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。

## 【0039】

前記の(12)「置換基を有するアリール基」のアリール基とは、前記(11)「置換基を有していないアリール基」のアリール基で定義したものと同一意味を示し、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。(12)「置換基を有するアリール基」の置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル、ブチル基(各異性体を含む)、ペンチル基(各異性体を含む)、ヘキシル基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルキル基；ヒドロキシル基；ニトロ基；シアノ基；ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子)；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基(各異性体を含む)、ブトキシ基(各異性体を含む)、ペンチルオキシ基(各異性体を含む)、ヘキシルオキシ基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルコキシ基；メチル基、エチル基、プロピル基等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルキル基で置換されていても良いアミノ基；ベンジルオキシ基等のアラルキルオキシ基；トリメチルシリルオキシ基等が挙げられるが、好ましくは炭素数1~6のアルキル基、炭素数1~6のアルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ベンジルオキシ基、トリメチ

ルシリルオキシ基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*tert*-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、*tert*-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、ベンジルオキシ基である。これらの置換基は、数や位置を限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していても良い。

## 【0040】

化合物 (I) において  $R^3$  が示すアラルキル基とは、(13) 「置換基を有していないアラルキル基」又は(14) 「置換基を有するアラルキル基」を意味する。

## 【0041】

前記の(13) 「置換基を有していないアラルキル基」としては、例えば、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、1-(2-ナフチル)エチル基等が挙げられるが、好ましくはベンジル基、2-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基、トリチル基、更に好ましくはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基である。

## 【0042】

前記の(14) 「置換基を有するアラルキル基」のアラルキル基とは、(13) 「置換基を有していないアラルキル基」で定義したアラルキル基と同じ意味を示し、好ましくはベンジル基、2-フェニルエチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基、トリチル基、更に好ましくはベンジル基、1-ナフチルメチル基、2-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、ジフェニルメチル基である。(14) の「置換基を有するアラルキル基」の置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル、ブチル基(各

異性体を含む)、ペンチル基(各異性体を含む)、ヘキシル基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルキル基;ヒドロキシル基;ニトロ基;シアノ基;ハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子);メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基(各異性体を含む)、ブトキシ基(各異性体を含む)、ペンチルオキシ基(各異性体を含む)、ヘキシルオキシ基(各異性体を含む)等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルコキシ基;メチル基、エチル基、プロピル基等の直鎖状又は分岐状の炭素数1~6のアルキル基で置換されていても良いアミノ基;ベンジルオキシ基等のアラルキルオキシ基;トリメチルシリルオキシ基等が挙げられるが、好ましくは炭素数1~6のアルキル基、炭素数1~6のアルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ベンジルオキシ基、トリメチルシリルオキシ基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*tert*-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、*tert*-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、ベンジルオキシ基である。これらの置換基は、数や位置を限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していても良い。

## 【0043】

化合物(I)の $R^3$ の具体例としては、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基、メンチル基、ビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、1-ペンテニル基、3-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、3-ヘプテニル基、4-ヘプテニル基、3-オクテニル基、3-ノネニル基、3-デセニル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、アントラセニル基、フェナントリル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、4-トリメチルシリルオキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-ニトロ

フェニル基、3-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、2-シアノフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、2-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、2-クロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ブロモフェニル基、4-ヨードフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、3-メトキシ-4-エトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、3,4-メチレンジオキシフェニル基、4-エチルフェニル基、4-(n-プロピル)フェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-モノメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、ジフェニルメチル基、トリチル基、4-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、4-エチルベンジル基、4-イソブチルベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、3,4-メチレンジオキシベンジル基、3,4-ジエトキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-トリメチルシリルオキシベンジル基、4-tert-ブチルジメチルシリルオキシベンジル基、4-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、2-ニトロベンジル基、4-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、2-フルオロベンジル基、4-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、2-クロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ヨードベンジル基、4-シアノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(4-tert-ブチルジメチルシリルオキシフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基等が挙げられるが、好ましくはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、sec-ブチル基

、tert-ブチル基、n-ヘキシル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、メンチル基、8-フェニルメンチル基、ビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、4-トリメチルシリルオキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ヨードフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、3,4-メチレンジオキシフェニル基、4-エチルフェニル基、4-n-プロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、4-メチルベンジル基、4-エチルベンジル基、4-イソブチルベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-tert-ブチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、3,4-メチレンジオキシベンジル基、3,4-ジエトキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、4-tert-ブチルジメチルシリルオキシベンジル基、4-ニトロベンジル基、2-ニトロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-フルオロベンジル基、4-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ヨードベンジル基、4-シアノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(4-tert-ブチルジメチルシリルオキシフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)

ル) エチル基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ヘキシル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、メンチル基、8-フェニルメンチル基、ビニル基、プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、4-トリメチルシリルオキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、4-ヨードフェニル基、4-メトキシフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、4-*tert*-ブトキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、ベンジル基、1-フェニルエチル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、1-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、1-ナフチルメチル基、4-メチルベンジル基、4-イソブチルベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-*tert*-ブチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3, 4-ジメトキシベンジル基、3, 4-メチレンジオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、4-*tert*-ブチルジメチルシリルオキシベンジル基、4-ニトロベンジル基、4-フルオロベンジル基、4-クロロベンジル基、4-ブロモベンジル基、4-ヨードベンジル基、4-シアノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(4-*tert*-ブチルジメチルシリルオキシフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基である。

## 【0044】

化合物(I)において $R^4$ が示すアルキル基とは、直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基(異性体を含む)

、ブチル基（各異性体を含む）、ペンチル基（各異性体を含む）、ヘキシル基（各異性体を含む）、ヘプチル基（各異性体を含む）、オクチル基（各異性体を含む）、ノニル基（各異性体を含む）、デシル基（各異性体を含む）、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基のような炭素数 1 ～ 10 の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基が挙げられるが、好ましくは炭素数 1 ～ 6 の直鎖状、分岐状又は環状のアルキル基、更に好ましくはメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基である。

## 【 0 0 4 5 】

化合物 (I) において  $R^4$  が示すアリール基とは、(15) 「置換基を有していないアリール基」又は(16) 「置換基を有するアリール基」を意味する。

## 【 0 0 4 6 】

前記の (15) 「置換基を有していないアリール基」としては、例えば、フェニル基、ナフチル基、アントラセニル基またはフェナントリル等が挙げられるが、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。

## 【 0 0 4 7 】

前記の (16) 「置換基を有するアリール基」のアリール基とは、(15) 「置換基を有していないアリール基」のアリール基で定義したものと同一意味を示し、好ましくはフェニル基、ナフチル基、更に好ましくはフェニル基である。(16) 「置換基を有するアリール基」の置換基としては、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル、ブチル基（各異性体を含む）、ペンチル基（各異性体を含む）、ヘキシル基（各異性体を含む）等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1 ～ 6 のアルキル基；ヒドロキシル基；ニトロ基；シアノ基；ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子）；メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基（各異性体を含む）、ブトキシ基（各異性体を含む）、ペンチルオキシ基（各異性体を含む）、ヘキシルオキシ基（各異性体を含む）等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1 ～ 6 のアルコキシ基；メチル基、エチル基、プロピル基



等の直鎖状又は分岐状の炭素数 1～6 のアルキル基で置換されていても良いアミノ基；ベンジルオキシ基等のアラルキルオキシ基；トリメチルシリルオキシ基等が挙げられるが、好ましくは炭素数 1～6 のアルキル基、炭素数 1～6 のアルコキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ベンジルオキシ基、トリメチルシリルオキシ基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*tert*-ブチル基、メトキシ基、エトキシ基、*tert*-ブトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、ベンジルオキシ基である。これらの置換基は、数や位置を限定されないし、同一又は異なる置換基が複数置換していても良い。

## 【0048】

化合物 (I) において  $R^4$  が示すアルコキシカルボニル基とは、直鎖状、分岐状又は環状の炭素数 1～6 のアルコキシカルボニル基を意味し、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基、*n*-ペンチルオキシカルボニル基、*n*-ヘキシルオキシカルボニル基、シクロプロポキシカルボニル基、シクロブトキシカルボニル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基等が挙げられるが、好ましくはメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基、シクロプロポキシカルボニル基、シクロブトキシカルボニル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、更に好ましくはメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基である。

## 【0049】

化合物 (I) の  $R^4$  の具体例としては、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシ

ル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロノニル基、シクロデシル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、4-トリメチルシリルオキシフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、2-シアノフェニル基、4-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、2-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、2-クロロフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ブロモフェニル基、4-ヨードフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、2-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、3-メトキシ-4-エトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、3,4-メチレンジオキシフェニル基、4-エチルフェニル基、4-n-プロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-モノメチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、シクロプロポキシカルボニル基、シクロブトキシカルボニル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、シアノ基等が挙げられるが、好ましくはメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ヘキシル基、シクロヘキシル基、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、シアノ基、更に好ましくは、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、tert-ブチル基、フェニル基、1-ナフチル

基、2-ナフチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、シアノ基である。

【0050】

上記のような置換基 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ を有する一般式(I)で表される化合物(I)の具体例としては、例えば、

3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-(1)-メンチルオキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-フェノキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-ベンジルオキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-tert-ブチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メトキシカルボニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-イソプロポキシカルボニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-エトキシカルボニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-シアノ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-フェニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-3a-メチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ジフェニルメチル-3a-フェニル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-エトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-フェノキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-ベンジルオキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-( (1)-メンチルオキシ)-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-n-ブチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-tert-ブチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-ベンジル-7a-メトキシ-6-フェニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オ

キサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - ベンジル - 3 a - メチル - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - ベンジル - 3 a - フェニルメチル - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - エトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - イソプロポキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - エチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - プロピル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - n - ブチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - t e r t - ブチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - メトキシカルボニル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - シアノ - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - ( (1) - メンチルオキシ) - 6 - シアノ - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 3 a - メチル - 7 a - メトキシ - 6 - t e r t - ブチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - フェニルエチル) - 7 a - メトキシ - 6 - フェニル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール-2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピ  
ラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - エトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピ  
ラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - イソプロポキシ - 6 - メチル - 4  
H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - エチル - 4 H - ピ  
ラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - n - ブチル - 4 H  
- ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - ヘキシル - 4 H -  
ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - メトキシカルボニ  
ル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - フェニル - 4 H -  
ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - (3, 4 - ジメト  
キシフェニル) - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 3 a - メチル - 7 a - メトキシ - 6 - メ  
チル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - フェニル - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキ  
サゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - メチル - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサ  
ゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (4 - ニトロベンジル) - 7 a - メトキシ - 6 - メチル - 4 H - ピラノ [3  
, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3 - (1 - (1 - ナフチル) エチル) - 7 a - メトキシ - 6 - tert - ブチル  
- 4 H - ピラノ [3, 2 - d] - オキサゾール - 2 (3 H) - オン、

3-ジフェニルメチル-3a-メチル-7a-メトキシ-6-n-ブチル-4H-  
-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-フェノキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-  
-d]-オキサゾール-2(3H)-オン

等が挙げられるが、好ましくは、

3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-  
-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-  
-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-メンチルオキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,  
2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-3a-メチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピ  
ラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-  
-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3,  
2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-tert-ブチル-4H-ピラノ  
[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-イソブチル-4H-ピラノ[3,  
2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-メトキシカルボニル-4H-ピラ  
ノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ジフェニルメチル-7a-エトキシ-6-フェニル-4H-ピラノ[3, 2-  
-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-フェニルエチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,  
2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-フェニルエチル)-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラ  
ノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-フェニルエチル)-7a-((1)-メンチルオキシ)-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-フェニルエチル)-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-フェニル)エチル-7a-メトキシ-6-(n-ブチル)-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-((1)-メンチルオキシ)-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-メトキシ-6-tert-ブチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-メトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-メトキシ-6-メトキシカルボニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-ベンジル-7a-メトキシ-6-フェニル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-ナフチル)メチル-7a-イソプロポキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-ナフチル)メチル-7a-メトキシ-6-エチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン、

3-(1-ナフチル)メチル-7a-メトキシ-6-tert-ブチル-4H-



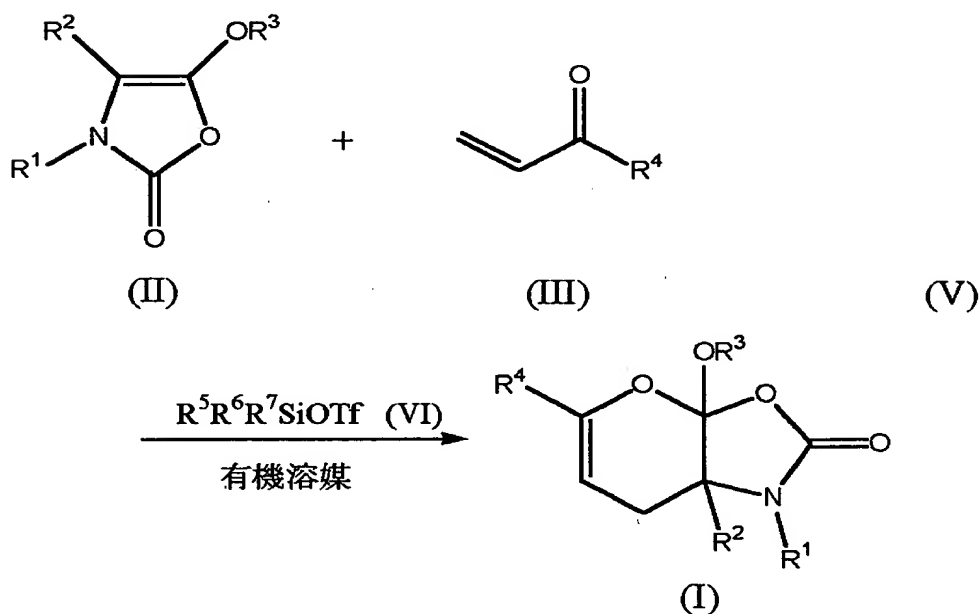
ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-(1-ナフチル)メチル-7a-メトキシ-6-イソプロピル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 更に好ましくは、  
 3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-(1-フェニルエチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン、  
 3-(1-(1-ナフチル)エチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン  
 である。

【0051】

本発明の一般式 (I) で示される 7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2 (3H)-オン類は、一般式 (V)

【0052】

【化10】



【0053】

(R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>及びTfは、前記と同義である。)

で示されるように、一般式 (VI) で示されるルイス酸の存在下、一般式 (II) で示される 5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類に、一般式 (III) で示される  $\alpha, \beta$ -不飽和ケトン類を有機溶媒中で反応させることによって製造される。

【 0 0 5 4 】

本発明の反応で使用する 5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類は、一般式 (II) で示される。その一般式 (I) において、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $R^3$  は、前記と同義である。

【 0 0 5 5 】

前記 5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類の具体例としては、例えば、

- 3-ベンジル-5-メトキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-エトキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-n-プロピルオキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-n-ブチルオキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-イソプロピルオキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-フェニルオキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-(4-ニトロフェニルオキシ)-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-ベンジルオキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-メンチル-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-5-(8-フェニルメンチルオキシ)-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-4-メチル-5-メトキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ベンジル-4-フェニルメチル-5-メトキシ-2-(3H)-オキサゾロン
- 3-ジフェニルメチル-5-メトキシ-2-(3H)-オキサゾロン
- 3-ジフェニルメチル-5-エトキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ジフェニルメチル-5-n-プロピルオキシ-2-(3H)-オキサゾロン、
- 3-ジフェニルメチル-5-n-ブチルオキシ-2-(3H)-オキサゾロン、

3-ジフェニルメチル-5-イソプロピルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-ジフェニルメチル-5-フェニルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-ジフェニルメチル-5-ベンジルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-ジフェニルメチル-5-メンチル-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-ジフェニルメチル-5-(8-フェニルメンチルオキシ)-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-ジフェニルメチル-4-メチル-5-メトキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-ジフェニルメチル-4-ベンジルオキシフェニルメチル-5-メトキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-ジフェニルメチル-4-フェニル-5-メトキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-メトキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-エトキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-n-プロピルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-n-ブチルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-イソプロピルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-フェニルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-(4-ニトロフェニル)オキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-ベンジルオキシ-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-メンチル-2 (3H) -オキサゾロン、  
3-(1-フェニルエチル)-5-(8-フェニルメンチルオキシ)-2 (3H) -オキサゾロン、

3-(1-フェニルエチル)-4-メチル-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-フェニルエチル)-4-フェニルメチル-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-フェニルエチル)-4-(2-フェニルエチル)-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-エトキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-イソプロポキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-フェニルオキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-ベンジルオキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-メントール-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-(8-フェニルメントールオキシ)-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-4-メチル-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-(1-(1-ナフチル)エチル)-4-フェニルメチル-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン、

3-フェニル-5-メトキシ-2(3H)オキサゾロン、

3-フェニル-4-メチル-5-メトキシ-2(3H)オキサゾロン、

3-フェニル-4-フェニルメチル-5-メトキシ-2(3H)オキサゾロン、

3-(2-メトキシフェニル)-5-メトキシ-2(3H)オキサゾロン、

3-(3-メトキシフェニル)-5-メトキシ-2(3H)オキサゾロン、

3 - (4 - メトキシフェニル) - 5 - メトキシ - 2 (3 H) オキサゾロン、  
 3 - メチル - 5 - メトキシ - 2 (3 H) オキサゾロン、  
 3 - メチル - 5 - ベンジルオキシ - 2 (3 H) オキサゾロン、  
 3 - メチル - 4 - メチル - 5 - メトキシ - 2 (3 H) オキサゾロン  
 等が挙げられる。

【 0 0 5 6 】

本発明の反応で使用する  $\alpha, \beta$  - 不飽和ケトン類は、一般式 (III) で示される。  
 その一般式 (III) において、 $R^4$  は、前記と同義である。

【 0 0 5 7 】

前記  $\alpha, \beta$  - 不飽和ケトン類の具体例としては、例えば、

3 - オキソ - 1 - ブテン、  
 3 - オキソ - 1 - ペンテン、  
 3 - オキソ - 1 - ヘキセン、  
 3 - オキソ - 1 - ヘプテン、  
 3 - オキソ - 1 - オクテン、  
 3 - オキソ - 1 - ノネン、  
 3 - オキソ - 1 - デセン、  
 3 - オキソ - 4 - メチル - 1 - ペンテン、  
 3 - オキソ - 5 - メチル - 1 - ヘキセン、  
 3 - オキソ - 4 - フェニル - 1 - ブテン、  
 3 - オキソ - 4 - ジメチル - 1 - ペンテン、  
 3 - オキソ - 3 - フェニル - 1 - プロペン、  
 3 - オキソ - 3 - (2 - ナフチル) - 1 - プロペン、  
 3 - オキソ - 4 - (2 - フリル) - 1 - ブテン、  
 3 - オキソ - 5 - メチル - 1 - ヘプテン、  
 3 - オキソ - 5 - エチル - 1 - ヘプテン、  
 3 - オキソ - 5 - メチル - 1 - オクテン、  
 3 - オキソ - 4, 4 - ジエチル - 1 - ヘキセン、  
 3 - オキソ - 7 - メチル - 1 - オクテン、

3-オキソ-5, 5-ジメチル-1-ヘキセン、  
 3-オキソ-3-(4-メチルフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(3-4-エチルフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(4-ブロモフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(4-クロロフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(4-ベンジルフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(4-メチルフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(4-ジメチルアミノフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(4-メトキシフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(2, 4-ジメトキシフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(3, 4-ジメトキシフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(2-ニトロフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(2-アセトキシフェニル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-(2-フェナントリル)-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-メトキシカルボニル-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-エトキシカルボニル-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-イソプロポキシカルボニル-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-tert-ブトキシカルボニル-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-ベンジルオキシカルボニル-1-ブテン、  
 3-オキソ-3-シアノ-1-ブテン

等が挙げられる。

【0058】

前記 $\alpha, \beta$ -不飽和ケトン類の使用量は、5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類1molに対して、好ましくは1.0~10.0mol、更に好ましくは1.0~5.0molである。

【0059】

本発明の反応で使用するルイス酸は、一般式(IV)で示される。その一般式(IV)において、 $R^5$ 、 $R^6$ 及び $R^7$ が示す炭素数1~6のアルキル基とは、直鎖状、分岐状又は環状の炭素数1~6のアルキル基を示し、例えば、メチル基、エチ

ル基、プロピル基（異性体を含む）、ブチル基（各異性体を含む）、ペンチル基（各異性体を含む）、ヘキシル基（各異性体を含む）が挙げられるが、好ましくはメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基である。

【 0 0 6 0 】

前記ルイス酸の具体例としては、例えば、  
トリメチルシリルトリフレート、  
トリエチルシリルトリフレート、  
トリ（*n*-プロピル）シリルトリフレート、  
*tert*-ブチルジメチルシリルトリフレート、  
トリイソプロピルシリルトリフレート  
等が挙げられる。

【 0 0 6 1 】

前記ルイス酸の使用量は、5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類1molに対して、好ましくは0.001~2.0mol、更に好ましくは0.005~0.5molである。

【 0 0 6 2 】

本発明の反応で使用する有機溶媒は、反応に関与しないものならば特に限定されず、例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリル、ベンゾニトリル等のニトリル類が挙げられるが、好ましくはハロゲン化脂肪族炭化水素類、更に好ましくは塩化メチレン、1,2-ジクロロエタンである。

【 0 0 6 3 】

前記有機溶媒の使用量は、溶液の均一性や攪拌性により適宜調節するが、5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類1molに対して、好ましくは0.5~100L、更に好ましくは1~30Lである。

【 0 0 6 4 】

本発明の反応は、例えば、不活性ガス雰囲気にて、5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類、 $\alpha, \beta$ -不飽和ケトン類、ルイス酸及び有機溶媒を混合して、好ましくは-80~200℃、更に好ましくは-78~30℃で反応させる等の方法によって行われる。その際の反応圧力は特に制限されない。

## 【 0 0 6 5 】

本発明の反応によって得られる7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類は、反応終了後、再結晶、蒸留、カラムクロマトグラフィー等による一般的な方法によって分離・精製される。

## 【 0 0 6 6 】

## 【実施例】

次に、実施例を挙げて本発明を具体的に説明するが、本発明の範囲はこれらに限定されるものではない。

## 【 0 0 6 7 】

## 実施例 1

攪拌装置、温度計及び滴下漏斗を備えた内容積50mlのガラス製フラスコに、窒素雰囲気にて、3-ジフェニルメチル-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン140.7mg(0.50mmol)及び塩化メチレン3.0mlを加えて-78℃に冷却した。次いで、メチルビニルケトン52.6mg(0.75mmol)及びトリメチルシリルトリフラート9.1 $\mu$ l(0.05mmol)を加え、同温度で2時間反応させた。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液15mlを加え、塩化メチレン15mlで抽出した。有機層(塩化メチレン層)を分液し、水15mlで2回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮して油状物200mgを得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒：n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1(容量比))で精製し、白色結晶として3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン158.4mgを得た(単離収率90%(3-ジフェニルメチル-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン基準))。

3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オンは、以下の物性値で示される新規な化合物である。



## 【0068】

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ (ppm),  $\text{CDCl}_3$ ) : 1.80 (m, 2H), 1.86 (s, 3H), 3.59 (s, 3H), 3.73-3.75 (m, 1H), 4.81-4.84 (m, 1H), 6.27 (s, 1H), 7.25-7.40 (m, 10H)

$^{12}\text{C-NMR}$  ( $\delta$ (ppm),  $\text{CDCl}_3$ ) : 19.1, 23.5, 50.5, 59.8, 51.1, 99.9, 115.9, 127.8, 128.1, 128.2, 128.5, 128.7, 128.8, 137.6, 138.6, 150.8, 155.2

MS (CI,  $i\text{-C}_4\text{H}_{10}$ )  $m/z$  : 352 ( $\text{MH}^+$ )

元素分析 (%) : calcd : C ; 72.58, H ; 5.37, N ; 4.98

Found : C ; 72.45, H ; 5.40, N, 4.98

## 【0069】

## 実施例2

攪拌装置、温度計及び滴下漏斗を備えた内容積50mlのガラス製フラスコに、窒素雰囲気にて、3-(R)-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン134.7mg(0.50mmol)及び塩化メチレン3.0mlを加えて-78℃に冷却した。次いで、メチルビニルケトン52.6mg(0.75mmol)及びトリメチルシリルトリフラート $9.1\mu\text{l}$ (0.05mmol)を加え、同温度で1時間反応させた。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液15mlを加え、塩化メチレン15mlで抽出した。有機層(塩化メチレン層)を分液し、水15mlで2回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮すると、ジアステレオマー混合物として3-(R)-(1-(1-ナフチル)エチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2(3H)-オンの油状物181mgを得た(ジアステレオマー間の生成比は66:34(高速液体クロマトグラフィーによる分析値))。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1(容量比))で精製し、主なジアステレオマーを白色結晶として76mg得た(単離収率45%(3-(R)-(1-(1-ナフチル)エチル)-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン基準))。

3-(R)-(1-(1-ナフチル)エチル)-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2(3H)-オンの主なジアステレオマーは、以下の物性値で示される新規な化合物である。

## 【0070】

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ (ppm),  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.72-0.79 (m, 1H), 1.23-1.31 (m, 1H), 1.67 (d,  $J=1.0\text{ Hz}$ , 3H), 1.76 (d,  $J=6.8\text{ Hz}$ , 3H), 3.57 (s, 3H), 3.80 (dd,  $J=5.3\text{ Hz}$ ,  $J=4.4\text{ Hz}$ , 1H), 1H) 3.94-3.98 (m, 1H), 5.99 (q,  $J=6.8\text{ Hz}$ , 1H), 7.42-7.59 (m, 4H), 7.85 (t,  $J=8.3\text{ Hz}$ , 2H), 8.18 (d,  $J=8.3\text{ Hz}$ , 1H)

$^{12}\text{C-NMR}$  ( $\delta$ (ppm),  $\text{CDCl}_3$ ) : 16.0, 18.8, 48.1, 50.4, 58.2, 100.5, 116.2, 123.8, 124.9, 126.2, 126.8, 128.6, 129.2, 131.9, 133.6, 135.0, 150.2, 155.1

MS (CI,  $i\text{-C}_4\text{H}_{10}$ )  $m/z$  : 340 ( $\text{MH}^+$ ), 155

IR (KBr法,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 1749.7

元素分析 (%) : Calcd : C; 70.78, H; 6.24, N; 4.13

Found : C; 70.79, H; 6.25, N; 4.18

## 【0071】

## 実施例3

攪拌装置、温度計及び滴下漏斗を備えた内容積50mlのガラス製フラスコに、窒素雰囲気にて、3-(R)-(1-フェニルエチル)-5-メトキシ-2(3H)-オキサゾロン134.7mg(0.50mmol)及び塩化メチレン3.0mlを加えて-78℃に冷却した。次いで、メチルビニルケトン52.6mg(0.75mmol)及びトリメチルシリルトリフラート $9.1\mu\text{l}$ (0.05mmol)を加え、同温度で1時間反応させた。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液15mlを加え、塩化メチレン15mlで抽出した。有機層(塩化メチレン層)を分液し、水15mlで2回洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮して油状物を得た。これをシリカゲル

カラムクロマトグラフィー（展開溶媒：n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1（容量比））で精製し、無色透明油状物としてジアステレオマー混合物の3-（R）-（1-フェニルエチル）-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2（3H）-オン114mg得た（単離収率67%（3-（R）-（1-フェニルエチル）-5-メトキシ-2（3H）-オキサゾロン基準）；ジアステレオマー間の生成比は65：35（高速液体クロマトグラフィーによる分析値））。

3-（R）-（1-フェニルエチル）-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2（3H）-オンのジアステレオマー混合物は、以下の物性値で示される新規な化合物である。

## 【0072】

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$  (ppm),  $\text{CDCl}_3$ )

major isomer: 1.52-1.61 (m, 2H), 1.23-1.31 (m, 1H), 1.67 (d,  $J=7.3\text{ Hz}$ , 3H), 1.78 (s, 3H), 3.59 (s, 3H), 3.56 (t,  $J=4.8\text{ Hz}$ , 1H), 3.92 (dd,  $J=3.4\text{ Hz}$ ,  $J=5.4\text{ Hz}$ , 1H), 5.17 (q,  $J=6.8\text{ Hz}$ , 1H), 7.23-7.43 (m, 5H)

minor isomer: 1.65 (d,  $J=7.3\text{ Hz}$ , 3H), 1.82 (s, 3H), 3.83-3.90 (m, 2H), 3.54 (s, 3H), 4.51-4.55 (m, 1H), 4.89 (t,  $J=5.4\text{ Hz}$ , 1H), 5.10 (q,  $J=7.3\text{ Hz}$ , 1H), 7.23-7.43 (m, 5H)

MS (CI,  $i\text{-C}_4\text{H}_{10}$ )  $m/z$ : 290 ( $\text{MH}^+$ ), 105

## 【0073】

参考例1（5-メチルプロリンメチルエステルのトリフルオロ酢酸塩の合成）

攪拌装置、温度計及び滴下漏斗を備えた内容積50mlのガラス製フラスコに、アルゴン雰囲気にて、実施例1の方法と同様にして合成した3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2（3H）-オン932.6mg(2.65mmol)、トリフルオロ酢酸906.5mg(7.95mmol)及び塩化メチレン26mlを加え、室温で17時間反応させた。その後、メタノール26ml及び5重量% Pd/C564mgを加え、水素ガス雰囲気(常圧)にて、室温で16時間反応

させた。反応終了後、濾過し、濾液を減圧下で濃縮し、無色透明油状物1228mgを得た。これを、ジエチルエーテル20mlで三回、n-ヘキサン20mlで二回、ジエチルエーテル20mlで一回の順で洗浄し、減圧下で乾燥させ、白色結晶として5-メチルプロリンメチルエステルのトリフルオロ酢酸塩534mgを得た(単離収率78%(3-ジフェニルメチル-7a-メトキシ-6-メチル-4H-ピラノ[3,2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン基準))。

5-メチルプロリンメチルエステルのトリフルオロ酢酸塩の物性値は、以下の通りである。

【0074】

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ (ppm),  $\text{CDCl}_3$ ) : 1.51 (d,  $J=6.4\text{ Hz}$ , 3H), 1.61-1.72 (m, 1H), 2.19-2.32 (m, 2H), 2.40-2.52 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.85-3.94 (m, 1H), 4.53 (dd,  $J=9.3\text{ Hz}$ ,  $J=4.9\text{ Hz}$ , 1H)

$^{13}\text{C-NMR}$  ( $\delta$ (ppm),  $\text{CDCl}_3$ ) : 17.7, 28.4, 31.4, 53.7, 56.8, 59.0, 170.3

MS (CI,  $i\text{-C}_4\text{H}_{10}$ )  $m/z$  : 144 ( $\text{MH}^+$ ), 84

元素分析 (%) : Calcd : C; 42.03, H; 5.49, N; 5.42

Found : C; 41.74, H; 5.48, N; 5.44

【0075】

【発明の効果】

本発明により、医薬・農薬の合成原料及び他のファインケミカル製品合成原料として利用出来る、新規な7a-アルコキシ-4H-ピラノ[2,3-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類、及びその製造法を提供することが出来る。

【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 本発明は、新規な 7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類、及びその製造法を提供することを課題とする。

【解決手段】 本発明の課題は、7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類、又、ルイス酸の存在下、5-アルコキシ-2-(3H)-オキサゾロン類に、 $\alpha$ ,  $\beta$ -不飽和ケトン類を溶媒中で反応させることを特徴とする、7a-アルコキシ-4H-ピラノ[3, 2-d]-オキサゾール-2(3H)-オン類の製造法によって解決される。

【選択図】 なし

特 2000-349456

認定・付加情報

特許出願の番号	特願2000-349456
受付番号	50001479698
書類名	特許願
担当官	第五担当上席 0094
作成日	平成12年11月17日

<認定情報・付加情報>

【提出日】	平成12年11月16日
-------	-------------

次頁無

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000000206]

1. 変更年月日 1990年 8月28日  
[変更理由] 新規登録  
住 所 山口県宇部市西本町1丁目12番32号  
氏 名 宇部興産株式会社
2. 変更年月日 2001年 1月 4日  
[変更理由] 住所変更  
住 所 山口県宇部市大字小串1978番地の96  
氏 名 宇部興産株式会社